

特許協力条約

PCT

REC'D 09 FEB 2006

WIPO

PCT

特許性に関する国際予備報告（特許協力条約第二章）

（法第 12 条、法施行規則第 56 条）

〔PCT 36 条及び PCT 規則 70〕

出願人又は代理人 の書類記号 664904	今後の手続きについては、様式 PCT/IPEA/416 を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP2004/018204	国際出願日 (日.月.年) 07.12.2004	優先日 (日.月.年) 09.12.2003
国際特許分類 (IPC) Int.Cl. <i>A61K9/14</i> (2006.01), <i>A61K9/20</i> (2006.01), <i>A61K47/38</i> (2006.01), <i>A61K47/10</i> (2006.01), <i>A61K31/5375</i> (2006.01)		
出願人 (氏名又は名称) 大日本住友製薬株式会社		

<p>1. この報告書は、PCT 35 条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。 法施行規則第 57 条 (PCT 36 条) の規定に従い送付する。</p> <p>2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 4 ページからなる。</p> <p>3. この報告には次の附属物件も添付されている。</p> <p>a. <input checked="" type="checkbox"/> 附属書類は全部で 3 ページである。</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 補正されて、この報告の基礎とされた及び／又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び／又は図面の用紙 (PCT 規則 70.16 及び実施細則第 607 号参照)</p> <p><input type="checkbox"/> 第 I 欄 4. 及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙</p> <p>b. <input type="checkbox"/> 電子媒体は全部で (電子媒体の種類、数を示す)。 配列表に関する補充欄に示すように、電子形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。 (実施細則第 802 号参照)</p>	
<p>4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第 I 欄 国際予備審査報告の基礎</p> <p><input type="checkbox"/> 第 II 欄 優先権</p> <p><input type="checkbox"/> 第 III 欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成</p> <p><input type="checkbox"/> 第 IV 欄 発明の単一性の欠如</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第 V 欄 PCT 35 条 (2) に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明</p> <p><input type="checkbox"/> 第 VI 欄 ある種の引用文献</p> <p><input type="checkbox"/> 第 VII 欄 国際出願の不備</p> <p><input type="checkbox"/> 第 VIII 欄 国際出願に対する意見</p>	

国際予備審査の請求書を受理した日 08.07.2005	国際予備審査報告を作成した日 01.02.2006	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号 100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目 4 番 3 号	特許庁審査官 (権限のある職員) 大久保 元浩	4C 8828
電話番号 03-3581-1101 内線 3452		

様式 PCT/IPEA/409 (表紙) (2005 年 4 月)

第 I 欄 報告の基礎

1. 言語に関し、この予備審査報告は以下のものを基礎とした。

- ☒ 出願時の言語による国際出願
- ☐ 出願時の言語から次の目的のための言語である _____ 語に翻訳された、この国際出願の翻訳文
- ☐ 国際調査 (PCT規則12.3(a)及び23.1(b))
- ☐ 国際公開 (PCT規則12.4(a))
- ☐ 国際予備審査 (PCT規則55.2(a)又は55.3(a))

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☐ 出願時の国際出願書類

☒ 明細書

第 1-34 _____ ページ、出願時に提出されたもの

第 _____ ページ*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

第 _____ ページ*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☒ 請求の範囲

第 4, 12-18, 21 _____ 項、出願時に提出されたもの

第 _____ 項*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの

第 1, 5-10, 11, 19, 20 _____ 項*、08.07.2005 付けで国際予備審査機関が受理したもの

第 _____ 項*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☒ 図面

第 1/1 _____ ページ、出願時に提出されたもの

第 _____ ページ/図*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

第 _____ ページ/図*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☒ 補正により、下記の書類が削除された。

☐ 明細書 第 _____ ページ

☒ 請求の範囲 第 2, 3 _____ 項

☐ 図面 第 _____ ページ/図

☐ 配列表 (具体的に記載すること) _____

☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) _____

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

☐ 明細書 第 _____ ページ

☐ 請求の範囲 第 _____ 項

☐ 図面 第 _____ ページ/図

☐ 配列表 (具体的に記載すること) _____

☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) _____

* 4. に該当する場合、その用紙に "superseded" と記入されることがある。

第Ⅴ欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条（PCT35条(2)）に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲	1, 4-21	有
	請求の範囲		無
進歩性 (IS)	請求の範囲	1, 4-21	有
	請求の範囲		無
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲	1, 4-21	有
	請求の範囲		無

2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

・文献1: JP 2002-512953 A (住友製薬株式会社) 2002.05.08 文献全体、特許請求の範囲、【0006】、実施例10 & WO 99/55320 A1 & AU 9935362 B & EP 1082109 A1 & US 6517870 B1

・文献2: WO 02/62320 A1 (FMC CORP) 2002.08.15 文献全体、claim27, 29, 30、p.2 第27行-p.5 第20行、example3 & EP 138003 A1 & AU 2002/242084 A1 & JP 2004-522752 A & US 2004/213839 A1

・文献3: JP 58-58145 A (田辺製薬株式会社) 1983.04.06 文献全体、p.2 左上欄第10-14行、実験例1、第1表 & EP 76515 A1

・文献4: US 6413541 B1 (DAINIPPON PHARM CO LTD) 2002.07.02 文献全体 & JP 11-263723 A

・文献5: WO 02/76462 A1 (DAINIPPON PHARM CO LTD) 2002.10.03 文献全体 & JP 2002-284687 A & AU 2002/239051 A1

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 V 欄の続き

- ・ (1) 不快な味を有する薬物、(2) メチルセルロース及び(3) マンニトールの三成分を共に混合し粒子化してなるものであり、成分(1) 1重量部に対して成分(2)を0.8～10重量部の割合で含む薬物含有粒子、

及び

- ・ 上記薬物含有粒子を製剤化してなる固形製剤、

については、国際調査報告で挙げられた上記文献1～5のいずれにも具体的に記載されていない。

そして、上記の薬物含有粒子を含有せしめてなる固形製剤とすることにより、出願人が答弁書中で比較データを以て示したように、三成分を共に粒子化することなく調製されたものと比較して不快味の遮蔽効果の点で優れた製剤が得られることが、上記文献から当業者にとり自明であったともいえない。

請 求 の 範 囲

1. (補正後) 下記の成分:

(1) 不快な味を有する薬物、

5 (2) メチルセルロースおよび

(3) マンニトール

を混合し粒子化してなる薬物の不快な味を低減した薬物含有粒子であって、不快な味を有する薬物1重量部に対して、メチルセルロースを約0.8～約10重量部程度の割合で含む薬物含有粒子。

10 2. (削除)

3. (削除)

4. 不快な味を有する薬物1重量部に対して、メチルセルロースを約0.8～約5重量部程度の割合で含む請求項1記載の薬物含有粒子。

15 5. (補正後) メチルセルロース1重量部に対して、マンニトールを約0.3～約50重量部程度の割合で含む請求項1または4に記載の薬物含有粒子。

6. (補正後) メチルセルロース1重量部に対して、マンニトールを約0.5～約12重量部程度の割合で含む請求項1または4に記載の薬物含有粒子。

7. (補正後) メチルセルロース1重量部に対して、マンニトールを約0.7～約7.5重量部程度の割合で含む請求項1または4に記載の薬物含有粒子。

20 8. (補正後) マンニトールがD-マンニトールである請求項1又は4～7のいずれかに記載の薬物含有粒子。

9. (補正後) 不快な味を有する薬物が、4-アミノ-5-クロロ-2-エトキシ-N-[[4-(4-フルオロベンジル)-2-モルホリニル]メチル]ベンズアミドまたはその生理学的に許容される塩である請求項1又は4～8のいずれかに記載の薬物含有粒子。

25 10. (補正後) (1) (±)-4-アミノ-5-クロロ-2-エトキシ-N-[[4-(4-フルオロベンジル)-2-モルホリニル]メチル]ベンズアミドのクエン酸塩2水和物、

(2) メチルセルロースおよび

(3) D-マンニトール

を混合し粒子化してなる請求項1に記載の薬物含有粒子であって、

(土) -4-アミノ-5-クロロ-2-エトキシ-N-[[4-(4-フルオ
ロベンジル)-2-モルホリニル]メチル]ベンズアミドのクエン酸塩 1重量
5 部に対してメチルセルロースを約0.8~約10重量部程度、メチルセルロース
1重量部に対してD-マンニトールを約0.3~約50重量部程度の割合で含む
薬物含有粒子。

11. (補正後) 請求項1又は4~10のいずれかに記載の薬物含有粒子と薬学
的に許容される製剤化成分を含む固形製剤。

12. 固形製剤が錠剤状製剤または粒状製剤である請求項11に記載の固形製剤。

13. 錠剤状製剤が錠剤または丸剤である請求項12に記載の固形製剤。

14. 粒状製剤が、顆粒剤、細粒剤または散剤である請求項12に記載の固形製
剤。

15. 固形製剤が口腔内速崩壊製剤である請求項11~14のいずれかに記載の
固形製剤。

16. 口腔内速崩壊製剤が錠剤である請求項15に記載の固形製剤。

17. 口腔内速崩壊製剤が粒状製剤である請求項15に記載の固形製剤。

18. 次の特性を備えることを特徴とする請求項15~17のいずれかに記載の
口腔内速崩壊製剤：

(i) 本製剤を健常成人の舌のうえに置き、閉口のまま噛まない状態において4
0秒以内に崩壊し、

(ii) 日本薬局方第14改正に記載の溶出試験（錠剤においては第2法（50回転
／分）、粒状製剤においては第1法（50回転／分）、溶媒：水900ml）に
おいて、15分後の溶出率が実質的に85%以上であり、

(iii) 本製剤を口に含むとき、実質的に不快な味を感じない。

19. (補正後) 請求項15に記載の口腔内速崩壊製剤を製造するための組成物
であって、不快な味を有する薬物、メチルセルロース及びマンニトールを混合し
粒子化してなる不快な味を低減した薬物含有粒子、賦形剤、並びに崩壊剤を含有
する組成物。

20. (補正後) (1) 不快な味を有する薬物、(2) 不快な味を有する薬物1重量部に対して、約0.8～約10重量部程度の量のメチルセルロースおよび(3) マンニトールを混合し、水または含水溶媒を用いて粒子化することを特徴とする薬物の不快な味を低減した薬物含有粒子の製造方法。

- 5 21. 不快な味を有する薬物として4-アミノ-5-クロロ-2-エトキシ-N-[[4-(4-フルオロベンジル)-2-モルホリニル]メチル]ベンズアミドまたはその生理学的に許容される塩を含む請求項11に記載の固形製剤及び当該固形製剤に関する記載物を含む商業パッケージであって、当該固形製剤を消化管運動機能促進、胃切除後症状の改善又は胃食道逆流症(GERD)の予防若しくは
- 10 治療に使用することができる又は使用すべきである旨の記載を、該パッケージ上又は該パッケージ内の記載物を含む商業パッケージ。